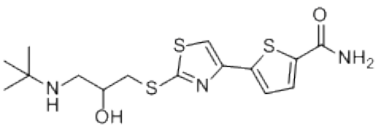




本PDF文件由

免费提供, 全部信息请点击[68377-92-4](#), 若要查询其它化学品请登录[CAS号查询网](#)如果您觉得本站对您的学习工作有帮助, 请与您的朋友一起分享:) [爱化学www.icchemistry.cn](#)

## CAS Number:68377-92-4 基本信息

中文名:	阿罗洛尔; 阿尔马乐
英文名:	2-Thiophenecarboxamide, 5-[2-[[3-[(1,1-dimethylethyl)amino]-2-hydroxypropyl]thio]-4-thiazolyl]-
别名:	2-Thiophenecarboxamide, 5-[2-[[3-[(1,1-dimethylethyl)amino]-2-hydroxypropyl]thio]-4-thiazolyl]-, (?à)-; (?à)-Arotinolol; 2-(3-tert-Butylamino-2-hydroxypropylthio)-4-(5-carbamoyl-2-thienyl)thiazole; Arotinolol; NSC 317940
分子结构:	
分子式:	C <sub>15</sub> H <sub>21</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub> S <sub>3</sub>
分子量:	371.54
CAS登录号:	68377-92-4

## 物理化学性质

性质描述:	阿罗洛尔(68377-92-4)的性状: 1. 从 <b>氯仿-石油醚</b> 结晶, 熔点148~149℃。 2. <b>盐酸</b> 阿罗洛尔(Arotinolol Hydrochloride): C <sub>15</sub> H <sub>21</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub> S <sub>3</sub> ·HCl。从 <b>甲醇-水</b> 结晶, 熔点234~235.5℃(分解)。 急性毒性LD <sub>50</sub> 小鼠(mg/kg): 86静脉注射, >360腹腔注射, >5000口服。
-------	--

CAS#68377-92-4化学试剂供应商(点击生产商链接可查看价格)

供应商信息已更新, 请登录爱化学 [CAS No. 68377-92-4](#) 查看  
若您在此化学品供应商, 请按照[化工产品收录](#)说明进行免费添加

## 其他信息

产品应用:	阿罗洛尔(68377-92-4)的用途: 该药是β-阻滞药, 还有一定的α-阻滞作用。其β阻滞作用是非选择性的, 作用比普萘洛尔强, 且持续时间长, 无膜稳定作用及内源性拟交感作用。用于轻度及中度原发性高血压、心肌梗死、频发性心律不齐等。
-------	--

1. 阿罗洛尔(68377-92-4)的生产方法:
- 以5-乙酰基-2-噻吩甲酸为原料。
- ①往5-乙酰基-2-噻吩甲酸的悬浮液中, 在剧烈搅拌下, 滴加22g(0.129mol)氯化亚砷在200mL甲苯中的溶液, 在微回流状态加热2h。反应液减压浓缩至干, 剩余物溶于150mL甲苯, 在10℃以下加入氨水反应。过滤收集析出的白色沉淀, 水洗, 干燥, 得20g5-乙酰基-2-噻吩甲酰胺, 收率92.8%, 熔点226~228℃。
- ②21.9g(0.131mol)5-乙酰基-2-噻吩甲酰胺溶于350mL热乙酸, 在80℃, 滴加21.9g(0.136mol)溴。加毕, 在相同温度反应1.5h。反应液浓缩至一半体积, 过滤, 用水彻底洗涤, 干燥, 得26.2g化合物(I), 收率80.6%, 熔点198~199℃(分解)。
- ③15.6g(0.138mol)氨基二硫代甲酸铵溶于145mL甲醇, 在5℃滴加26.2g(0.106mol)化合物(I)在260mL二甲基甲酰胺中的溶液。加毕, 在室温搅拌3h, 再回流2h。加入150mL水, 冷至0℃过夜。过滤收集沉淀, 水洗, 干燥, 得19.6g化合物(II), 收率76.7%, 熔点263~265℃(分解)。

④3.2g(0.0132mol)化合物(II)溶于20mL0.3%[氢氧化钠](#)水溶液中,加入1.26g(0.008mol)1-氯-3-(叔丁基氨基)-2-丙醇盐酸盐在20mL甲醇的溶液,并维持反应液的温度为20℃。加毕,在室温下搅拌4h。反应液浓缩至一半体积,剩余物和100mL水混合,用氯仿提取。提取液水洗,干燥,减压浓缩。剩余的4.8g,用氯仿-轻石油醚重结晶,得4.0g针状的阿罗洛尔(68377-92-4),收率74.3%,熔点148~149℃。

⑤把阿罗洛尔(68377-92-4)和溶于甲醇的浓盐酸作用,再用甲醇-水(1:1)重结晶,可得盐酸阿罗洛尔,收率80%,熔点234~235.5℃(分解)。

## 2. 说明:

片剂: 每片5mg; 10mg。滴眼剂: 0.5%。

## 3. 功用作用:

可阻断 $\alpha$ 及 $\beta$ 受体,但阻断 $\alpha$ 受体的作用较弱,阻断 $\alpha$ 受体与 $\beta$ 受体的比为1:8,故其体位性低血压作用甚弱。其阻断 $\beta$ -受体的作用比普萘洛尔者强。无膜稳定作用,亦无内在活性。本品可使血压降低,使亢进的心功能降低,使心肌耗氧量减少。

本品滴眼后可降低眼内压,其0.50%溶液的降眼内压强度与0.5%噻吗洛尔溶液者相当。滴眼后1小时见效。

本品适用于轻度至中度高血压,心绞痛及快速型心律失常。

## 4. 用法用量:

口服,10mg/次,1日2次,可根据降压情况逐渐增量至15mg/次,1日2次。其0.5%溶液可用于青光眼,每次1滴,1日2次。

如疗效不显著时,可酌情增加用药量。术前48h停药,对心动过缓用阿托品,严重低血压可用 $\beta$ 受体激动药。长期口服本品的患者应定期复查肝、肾及心功能,并需注意血象变化。

## 5. 注意事项:

(1)不良反应发生率约9%,主要有心动过缓,心悸,头痛,头晕,失眠,乏力,腹痛,稀便,食欲不振,恶心,肝功异常,偶见过敏反应。滴眼后可有雾视及泪液分泌减少。

(2)严重心动过缓、II~III度房室传导阻滞、窦房传导阻滞、充血性心力衰竭、心源性休克、支气管哮喘及糖尿病性酮症酸中毒者及授乳妇禁用。

## 6. 药理药动:

生产方法及其他:

本品是一种具有选择性 $\beta_1$ -受体阻滞、兼有微弱的 $\alpha_1$ -受体阻滞作用的新型药物。经放射性配体结合研究证明,本品与 $\beta_1$ 和 $\alpha_1$ -受体亲和力上存在着差异,人体以 $\beta$ -受体阻滞占优势, $\alpha$ -受体的阻滞活性较弱。因此,可降低冠脉和外周血管阻力,起到降压和减少心肌耗量的作用。此外,还具有抗心律失常作用。

## 7. 药动学:

本品主要分布于肝脏、肾脏和肺脏。达峰时间约为2h,消除半减期为10h,连续口服无蓄积现象。本品主要代谢物为氨基甲酰基水解后的活性代谢物,经尿排出体外。

## 8. 适应症:

本品适用于治疗原发性高血压、心绞痛及快速型心律失常。

## 9. 阿罗洛尔(68377-92-4)的不良反应:

(1)偶见的副反应有心动过缓、心悸、气喘、胸部不适、步态不稳、四肢无力、浮肿、肢麻、头痛、眩晕、食欲不振、腹部不适、恶心、呕吐、尿素氮、谷丙和谷草转氨酶值升高。较为罕见的症状为便秘、咳嗽、皮疹、房颤、房室传导阻滞、视神经疲劳、肌痛、空腹时血糖值上升、碱性[磷酸酶](#)和乳酸脱氢酶值升高。

(2)偶见心动过缓、胸部不适、头晕、步态不稳、起立时眩晕、心悸、气喘,罕见心房颤动、房室阻滞恶化、外周循环障碍。

(3)偶见四肢无力、倦怠感、头痛、头重、嗜睡、抑郁、失眠等。

(4)偶见软便、腹泻、腹部不适、腹痛、食欲不振、恶心、呕吐,罕见便秘。

(5)偶见SGOT、SGPT值上升,罕见碱性[磷酸酯酶](#)、LDH值上升。

(6)罕见咳嗽。

(7)泪液分泌减少时应停药。

(8)偶见雾视,罕见视神经疲劳。

(9)罕见皮疹、灼热感,应停药。

(10)偶见浮肿,麻木,中性脂肪值、尿酸值、BUN上升,心胸廓比值增大。

(11)罕见肌肉痛、空腹时血糖值上升。

(12)服用其它β-受体阻滞药时可出现血清肌酸磷酸激酶值上升。

(13)试用于1174例患者,有105例(8.9%)发生不良反应,有27例(2.3%)发生临床检查值异常。

#### 10. 阿罗洛尔(68377-92-4)的禁忌症:

本品禁用于高度房室传导阻滞、显著心动过缓、窦房阻滞、重度心力衰竭和心源性休克及严重哮喘或支气管痉挛患者。未询问有无哮喘既往史或现在史时,不得使用β-受体阻滞药。禁用于糖尿病性酮症酸中毒和代谢性酸中毒患者。

对正在治疗的心力衰竭、心脏扩大但无衰竭的临床征象、特发性低血糖、严重肝肾功能障碍、血糖未完全控制的糖尿病及高龄患者均要谨慎使用,严密观察,必要时减量或停药。

(1)禁用于严重心动过缓、房室阻滞和窦房阻滞的患者,糖尿病性酮酸中毒、代谢性酸中毒患者,可能发生支气管哮喘、支气管痉挛的患者,心源性休克患者,肺动脉高血压引起的右心衰竭患者,充血性心力衰竭患者以及孕妇或可能怀孕的妇女。

(2)慎用于可能发生充血性心力衰竭的患者,特发性低血糖和未完全控制的糖尿病患者,长期绝食的患者,严重肝、肾功能障碍患者及高龄患者。小儿慎用。授乳妇女用药应避免授乳。

#### 11. 药物相互作用:

与对交感神经系统有抑制作用的其它药物(利血平等)合用时,可引起过度抑制,需减量;与降血糖药合用时可增强降血糖作用;与钙拮抗剂(异搏定、乳酸心可定)合用时可相互增强作用;与吡二丙胺、普鲁卡因胺、阿马林合用时,可过度抑制心功能,需减量。此外本品能增强氯压定停药后的反跳现象。

### 相关化学品信息

[氧化环己烷不挥发残留物](#) [α-磷酸基-ω-十五烷氧基-聚\(氧-1,2-乙二基\)](#) [3,7-二甲基-6-辛烯基-3-甲基丁酸酯](#) [硅酸锌](#) [妥尔油与4,4'-\(1-甲基亚乙基\)双酚和环氧氯丙烷的聚合物](#) [\[2,4-二氢化-4-\(2-羟基-5-硝苯基\)偶氮\]-5-甲基-2-苯基-3H-吡啶-3-盐基\(2-\)\]](#) [\[3-\[\(4,5-二氢化-3-甲基-5-氧代-1-苯基-1H-吡啶-4-基\)偶氮\]-4-羟基-缩水甘油12-14烷基醚](#) [N,0-二\(三氟乙酰\)羟基胺](#) [丁醛与丁胺的反应产物](#) [N-\[2-\[\[2-\[\(2-氨基乙基\)氨基\]乙基\]氨基\]乙基\]氨基\]乙基\]辛酰胺](#) [2-羟基苯甲酸与2-\(二甲基氨基\)乙醇的化合物](#) [乙酰基氧代乙烯基、甲氧基-3-\(环氧乙烷基甲氧\)丙基\(硅氧烷与聚硅氧烷\)、3-\(环氧乙烷基甲氧\)丙基乙烯基、硅倍半环氧乙烷的聚合物](#) [掺杂铈的氧化钇](#) [68153-01-5](#) [\[\[4-\[乙基\[2-\[\[\[\(苯胺基\)羰基\]氧\]乙基\]氨基\]-2-甲基苯基\]亚甲基\]丙二腈](#) [硝酸银](#) [无水碳酸钾](#) [硫醚](#) 774